

⑯ BUNDESREPUBLIK  
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES  
PATENTAMT

⑯ **Patentschrift**  
⑯ **DE 196 18 809 C 1**

⑯ Int. Cl. 6:  
**A 61 K 7/48**  
A 61 K 7/02

DE 196 18 809 C 1

⑯ Aktenzeichen: 196 18 809.1-41  
⑯ Anm. Idetag: 10. 5. 96  
⑯ Offenlegungstag: —  
⑯ Veröffentlichungstag der Patenterteilung: 11. 12. 97

Innerhalb von 3 Monaten nach Veröffentlichung der Erteilung kann Einspruch erhoben werden

⑯ Patentinhaber:

Goldwell GmbH, 64297 Darmstadt, DE

⑯ Erfinder:

Beckmann, geb. Fischer, Monika, 69514 Laudenbach, DE; Eckhardt, Britta, 64354 Reinheim, DE; Kaiser, Brigitte, 64401 Groß-Bieberau, DE; Göring, Stefan, Dr., 65817 Eppstein, DE

⑯ Für die Beurteilung der Patentfähigkeit in Betracht gezogene Druckschriften:

DE 43 02 132 C1  
Brunke, Charlet: »Produktion und Nachweis von Liposomen, Sphingosomen und Nauopartikeln« in Seifen-Öle-Fette-Wachse Nr.14/91, S.514-517; Patent Abstracts of Japan: Nr. 07010731 A vom 13.01.95; Patent Abstracts of Japan, 1993 Vol.17/Nr.659, 5-213731 (A); Patent Abstracts of Japan, 1993 Vol.17/Nr.627, 5-194172 (A);

⑯ Kosmetisches Mittel

⑯ Die Erfindung betrifft ein kosmetisches Mittel auf wässriger Basis zur topischen Applikation auf Haut und Haar, das eine Nanoemulsion mit einem Gehalt an N-(3-Hexadecyloxy-2-hydroxypropyl)-N-2-hydroxyethylhexadecanamid enthält.

DE 196 18 809 C 1

## Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft ein kosmetisches Mittel, insbesondere zur topischen Behandlung der Haut, mit verbesserten Gebrauchseigenschaften

5 N-(3-Hexadecyloxy-2-hydroxypropyl)-N-2-hydroxyethylhexadecanamid ist als Wirkstoff in kosmetischen Mitteln, insbesondere als Feuchthaltefaktor für die äußeren Hautschichten, bekannt und wird auch dementsprechend eingesetzt.

10 Es wird in diesem Zusammenhang auf die JP 07010731 A sowie die Patent Abstracts of Japan, C-1137 December 7, 1993, Vol. 17/No. 659, 5-213 731, und C-1131 November 19, 1993, Vol. 17/No. 627, 5-194 172, verwiesen.

15 Da dieser Wirkstoff jedoch wasserunlöslich ist, kann er in wässrige Systeme wie Dispersionen, Emulsionen oder Gele nur schwer oder überhaupt nicht eingearbeitet werden, was natürlich seine gleichmäßige Aufbringung auf das zu behandelnde Substrat, insbesondere die menschliche Haut, schwierig bis unmöglich macht.

20 Durch die vorliegende Erfindung wird dieses Problem gelöst.

25 Gegenstand der Erfindung ist ein kosmetisches Mittel auf wässriger Basis, das etwa 0,05 bis etwa 20 Gew.-%, vorzugsweise 0,1 bis 10 Gew.-%, insbesondere 0,5 bis 5 Gew.-%, berechnet auf die Gesamtzusammensetzung des Mittels, einer Nanoemulsion enthält, die einen Gehalt von 0,5 bis 20 Gew.-%, insbesondere 1 bis 10 Gew.-%, berechnet auf die Nanoemulsion, an N-(3-Hexadecyloxy-2-hydroxypropyl)-N-2-hydroxyethylhexadecanamid aufweist.

30 Durch den Einsatz in einer Nanoemulsion kann dieser Wirkstoff gut in wässrige Trägersysteme inkorporiert werden.

35 Bei der Aufbringung der Zusammensetzung auf das zu behandelnde Substrat, z. B. die Haut, wird der Wirkstoff gleichmäßig verteilt und kann nach dem Aufbrechen der Nanopartikel seine Wirkung entfalten.

40 Die Herstellung der den Wirkstoff enthaltenden Nanopartikel erfolgt in an sich bekannter Weise als Nanoemulsion durch Hochdruckhomogenisierung in einem Mikrofluidizer, vorzugsweise unter Verwendung von Phospholipiden, insbesondere Lecithin, als Kapselwandmaterial.

45 Ein geeignetes Verfahren ist beispielsweise bei E. Mayhew et al., Biochimica et Biophysica Acta, Vol. 775 (1984), S. 169 – 174, sowie in der Veröffentlichung von J. Gareiß et al., Parfümerie und Kosmetik, Nr. 10/1994, S. 652 – 659, beschrieben.

50 Der durchschnittliche Teilchendurchmesser der erfindungsgemäß eingesetzten Nanoemulsion liegt zwischen etwa 10 und etwa 600 nm, vorzugsweise zwischen etwa 25 und etwa 300 nm, insbesondere etwa 40 und etwa 200 nm.

55 Sowohl die erfindungsgemäßen Nanoemulsionen als auch die diese enthaltenden Fertigprodukte können natürlich noch weitere hautpflegende Substanzen neben dem essentiellen N-(3-Hexadecyloxy-2-hydroxypropyl)-N-2-hydroxyethylhexadecanamid enthalten.

60 Solche sind beispielsweise pflegende Öle, wobei im Prinzip alle für diesen Zweck vorgeschlagenen natürlichen und synthetischen Öle zum Einsatz gelangen können, vorausgesetzt selbstverständlich, daß sie keine Hautirritationen hervorrufen. Derartige pflegende ölige Substanzen sind dem Fachmann aus den einschlägigen Handbüchern bekannt, vgl. beispielsweise K. Schrader, "Grundlagen und Rezepturen der Kosmetika", 2. Auflage (1989, Hüthig Buchverlag Heidelberg), S. 410 sowie S. 332 bis 341.

65 Der Anteil der ölichen Substanzen in den Nanoemulsionen liegt dabei vorzugsweise zwischen etwa 3 und etwa 30, insbesondere 10 bis 25 Gewichtsprozent, bezogen auf die Nanoemulsion.

70 Bevorzugte Öle sind beispielsweise Pflanzenöle wie Sojaöl, Erdnußöl, Olivenöl, Avocadoöl, Mandelöl, Pfirsichkernöl, Jojobaöl, Nachtkerzenöl, Macadamianußöl oder Weizenkeimöl; bevorzugte synthetische Öle sind insbesondere die Ester höherer Fettsäuren wie Isopropylmyristat, -palmitat oder -isostearat, Dicarbonsäureester wie Diisopropyladipat, Fettalkohole, höhere Kohlenwasserstoffe wie Paraffinöl, die bekannten Siliconöle, Polyolfettsäureester, etc.

75 Die erfindungsgemäßen Mittel können selbstverständlich noch weitere lipophile Bestandteile enthalten. Als solche seien, gemäß einer bevorzugten Ausführungsform der Erfindung, öllösliche Vitamine bzw. deren öllösliche Derivate genannt, beispielsweise Vitamin A-palmitat und Vitamin E-acetat oder -propionat.

80 Weitere geeignete Ingredientien sind UV-Absorber (falls es sich um Sonnenschutzmittel handelt), Feuchthaltemittel wie Glycerin und dessen Oligomere, weitere Polyalkohole, das Natriumsalz der -Pyrrolidoncarbonsäure, Harnstoff, Milchsäure und deren Salze, Aminosäuren, die unter der Handelsbezeichnung "Hydroviton" erhältliche Nachstellung des natürlichen Feuchthaltefaktors (NMF), Pflanzenextrakte, entweder als ölige Extrakte in den Nanosomen und/oder als wässrige Extrakte in der Gesamtzusammensetzung, vorzugsweise in einer Menge zwischen etwa 0,05 und 5, insbesondere 0,1 bis 3 Gew.-%, der Gesamtzusammensetzung.

85 Auch hier sind im Prinzip sämtliche Pflanzenauszüge geeignet, die in kosmetischen Mitteln eingesetzt werden, beispielsweise Auszüge aus den Blättern, Wurzeln und Blüten von Birken, Brennesseln, Kamille, Klette, Baldrian, Hamamelis, Melisse, Calendula, Gurken, Rosmarin, Salbei, Klettenwurzel, Huflattich, Aloe, Ginkgo, Weißdorn, etc.

90 Es wird auch hier auf die Monographie von K. Schrader, Ic, S. 388 – 591, beispielhaft Bezug genommen.

95 Diese und andere Zusatzstoffe können sowohl in der Nanoemulsion als auch in der diese enthaltenden Gesamtzusammensetzung vorhanden sein.

100 Wie bereits ausgeführt, liegen die erfindungsgemäßen Mittel als wässrige Dispersionen, Öl-in-Wasser- und Wasser-in-Öl-Emulsionen, Lotionen oder Gele vor, die gegebenenfalls auch als Aerosolschäume konfektioniert sein können.

105 Diese Zusammensetzungen enthalten die bekannten Grund- und Zusatzstoffe, es wird hierzu wiederum auf den bekannten Stand der Technik verwiesen, wie er beispielweise bei Schrader, Ic, S. 387 bis 590, beschrieben

ist.

Die erfindungsgemäße Zusammensetzung ist, wie bereits erwähnt, nicht auf hautkosmetische Mittel beschränkt, sondern kann auch in Haarpflegemitteln, insbesondere Haarwässern, Gelen oder Kuren, Verwendung finden.

Bezüglich der hierfür in Betracht kommenden Rahmenrezepturen wird wiederum auf Schrader, I.c., S. 722 bis 5 737, und, in Bezug auf Haarwässer, auf S. 763 bis 771 verwiesen; diese Veröffentlichung wird durch Zitierung in die Beschreibung eingeführt.

Eine weitere Substanz, durch deren Mitverwendung in den erfindungsgemäßen kosmetischen Mitteln die hauptpflegende Wirkung, insbesondere die Feuchthaltewirkung, noch gesteigert werden kann und auch, bei Anwendung als Haarpflegemittel, eine zusätzliche Schutzwirkung auf dem Haar erzielt wird, ist Carboxymethylchitin, das in einer Menge von 0,25 bis 2,5 Gewichtsprozent, bezogen auf die Gesamtzusammensetzung, zum Einsatz gelangt.

Carboxymethylchitin ist ein wasserlösliches Derivat des Chitins, das durch Einführung einer Carboxymethylgruppe wasserlöslich gemacht wurde.

Die folgenden Ausführungsbeispiele illustrieren die Erfindung.

5

10

15

### Nanoemulsion 1

Durch Hochdruckhomogenisierung in einem Mikrofluidizer wurde auf an sich bekannte Weise eine homogene Nanoemulsion erhalten, die folgenden Zusammensetzung aufwies:

20

#### Phase 1

Lecithin	5,0 (Gew.-%)	
N-Cetylisopropanol-Palmitamide MEA	4,0	25
Glycerin	8,0	
Avocadin® (Unverseifbares des Avocadoöls)	8,0	
Ethanol	10,0	
Diisopropyladipat	2,5	30

#### Phase 2

Wasser	@ 100,0 (Gew.-%)	35
--------	------------------	----

Die Partikelgröße lag bei  $100 \pm 30$  nm.

### Nanoemulsion 2

40

Auf gleiche Weise wurde eine Nanoemulsion erhalten, die folgende Zusammensetzung aufwies:

#### Phase 1

Phospholipide (enthaltend 50% Phosphatidylcholin)	3 (Gew.-%)	45
N-(3-Hexadecyloxy-2-hydroxypropyl)-N-2-hydroxyethylhexadecanamid	2	
Vitamin-E-acetat	15	
Ethanol	10	
Glycerin	25	50

#### Phase 2

Wasser	@ 100 (Gew.-%)	55
--------	----------------	----

Partikelgröße:  $220 \pm 60$  nm.

60

65

## Beispiel 1

## Hautpflege-Gel

5	Polyglycerylmethacrylat	0,8 (Gew.-%)
	Nanoemulsion 1	1,0
	Natriumlactat	1,5
	Xanthan Gum	0,5
10	Glycerin	2,0
	1,2-Propandiol	1,0
	1,3-Butandiol	2,0
	Dimethicone Copolyol	6,0
	Carboxymethylchitin	2,0
15	Panthenol	0,2
	Ginkgoextrakt	0,1
	Konservierungsmittel (p-Hydroxybenzoësäureester + Phenoxyethanol)	0,4
	Benzophenone-4	0,5
20	Polysorbate 60	0,5
	Glycin	0,1
	Blauer Farbstoff	q.s.
	Wasser	@ 100,0

25 Es wurde ein stabiles, homogenes Produkt erhalten, das sich gut auf die Haut auftragen ließ und in die oberen Hautschichten penetrierte.

## Beispiel 2

## Pflege-Tonic

30	Polyglycerylmethacrylat	0,1 (Gew.-%)
	Glycerin	7,5
	1,3-Butandiol	5,0
35	Nanoemulsion 2	0,5
	Carboxymethylchitin	0,5
	Panthenol	1,0
	Gurkenextrakt	0,1
40	Melissenextrakt	0,1
	Natriumsalz der Pyrrolidoncarbonsäure	0,1
	Polyamino-Zucker-Kondensat	0,3
	Konservierungsmittel (PHB-Ester + Phenoxyethanol)	0,3
45	Wasser	@ 100,0

Es wurde ein stabiles, homogenes, insbesondere als Gesichtswasser geeignetes Tonic erhalten.

## Beispiel 3

## Augen-Makeup-Entferner

50	1,2-Propandiol	3,0 (Gew.-%)
	Glycerin	3,5
55	Nanoemulsion 1	1,0
	PEG-7-Glycerylcocoat	12,0
	Decylpolyglucose	2,0
	Benzalkoniumchlorid	0,1
60	PHB-Ester	0,3
	Wasser	@ 100,0

Es wurde eine stabile, opake, gut auftragbare Flüssigkeit erhalten.

## Beispiel 4

## Hautpflegemittel

Natriumhyaluronat	0,05 (Gew.-%)	5
Nanoemulsion 2	2,00	
Bisabolol	0,05	
Panthenol	0,20	
Glycerin	5,10	10
Octyldodecanol	1,00	
PEG-40 Hydriertes Ricinusöl	3,50	
Acrylamid/Natriumacrylat-Copolymerisat	0,30	
Benzalkoniumchlorid	0,05	
Wasser	@ 100,00	15

Es wurde eine stabile, gut auftragbare und in die Haut penetrierende Flüssigkeit erhalten.

## Beispiel 5

## Hautcreme

Nanoemulsion 1	2,0 (Gew.-%)	25
Glycerin	3,0	
1,2-Propandiol	3,0	
PEG-100-stearate	6,0	
Polysorbate 60	1,0	
Cetylstearylalkohol	2,0	30
Mineralöl (Paraffinum liquidum)	6,0	
Hydriertes Polyisobutene	2,0	
Lanolinalkohol	3,0	
Bienenwachs	1,5	
Capryl-/Caprinsäuretriglycerid	8,0	35
Ginkgoextrakt	1,5	
Panthenol	0,3	
Glycin	0,2	
Konservierungsmittel (PHB-Ester + Phenoxyethanol)	0,5	
Lecithin	1,0	40
Wasser	@ 100,0	

Es wurde eine homogene, schnell in die oberen Hautschichten eindringende Creme erhalten.

## Patentansprüche

1. Kosmetisches Mittel auf wässriger Basis, enthaltend 0,05 bis 20 Gew.-%, berechnet auf die Gesamtzusammensetzung des Mittels, einer Nanoemulsion, die einen Gehalt von 0,5 bis 20 Gew.-%, berechnet auf die Nanoemulsion, N-(3-Hexadecyloxy-2-hydroxypropyl)-N-2-hydroxyethylhexadecanamid aufweist.
2. Kosmetisches Mittel, enthaltend 0,1 bis 10 Gew.-% der Nanoemulsion nach Anspruch 1, berechnet auf die Gesamtzusammensetzung des Mittels.
3. Kosmetisches Mittel nach Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß die Nanoemulsion 1 bis 10 Gew.-%, berechnet auf die Nanoemulsion, N-(3-Hexadecyloxy-2-hydroxypropyl)-N-2-hydroxyethylhexadecanamid enthält.
4. Kosmetisches Mittel nach einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 3, enthaltend mindestens einen Pflanzenextrakt.
5. Kosmetisches Mittel nach einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4, enthaltend mindestens ein zusätzliches Feuchthaltemittel.
6. Kosmetisches Mittel nach einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, daß die Nanoemulsion einen mittleren Teilchendurchmesser von 10 bis 600 Nanometern aufweist.
7. Kosmetisches Mittel nach Anspruch 6, dadurch gekennzeichnet, daß die Nanoemulsion einen mittleren Teilchendurchmesser von 25 bis 300 Nanometern aufweist.

**- Leerseite -**